

DE3518078

Publication Title:

ARZNEIMITTEL, DIE DERIVATE DES PROLIN ODER HYDROXYPROLIN
ENTHALTEN

Abstract:

Abstract of DE3518078

Medecines which contain, as active ingredients, derivatives of proline and hydroxyproline and are intended for improving the treatment of cancerous and viral diseases, including those of the circulatory and nervous systems. Data supplied from the esp@cenet database - Worldwide

Courtesy of <http://v3.espacenet.com>

①⑨ BUNDESREPUBLIK
DEUTSCHLAND



DEUTSCHES
PATENTAMT

①⑫ **Offenlegungsschrift**
①⑪ **DE 35 18 078 A 1**

⑤① Int. Cl. 4:
C07 D 207/16
A 61 K 31/40
A 61 K 45/05

②① Aktenzeichen: P 35 18 078.1
②② Anmeldetag: 20. 5. 85
④③ Offenlegungstag: 20. 11. 86

Behördensigntum

DE 35 18 078 A 1

⑦① Anmelder:
Hoerrmann, Wilhelm, Dr., 8127 Iffeldorf, DE

⑦② Erfinder:
gleich Anmelder

⑤④ Arzneimittel, die Derivate des Prolin oder Hydroxyprolin enthalten

Die vorliegende Erfindung beinhaltet Arzneimittel, die als Wirksubstanz Derivate des Prolin und Hydroxyprolin enthalten, und für die Verbesserung der therapeutischen Situation bei Krebs- und Viruserkrankungen und solchen des Gefäß- und Nervensystems bestimmt sind.

DE 35 18 078 A 1

Patentansprüche

1. Arzneimittel, enthaltend als Wirksubstanz mindestens ein Derivat des Prolin oder Hydroxyprolin oder dessen pharmazeutisch annehmbaren Abkömmling, ggf. zusammen mit üblichen Trägern und/oder Hilfsmitteln.
2. Arzneimittel nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass es sich um N-Alkyl-Derivate des Prolin oder Hydroxyprolin handelt.
3. Arzneimittel nach einem der Ansprüche 1 - 2, dadurch gekennzeichnet, dass es sich um die N-Methyl-Derivate des Prolin oder Hydroxyprolin handelt.
4. Arzneimittel nach einem der Ansprüche 1 - 3, wobei es sich um die l- oder d-Konfiguration der Derivate des Prolin oder Hydroxyprolin handelt.
5. Arzneimittel nach einem der Ansprüche 1 - 4, wobei es sich um das cis- oder trans-Isomere der Derivate des Hydroxyprolin handelt.
6. Arzneimittel nach einem der Ansprüche 1 - 5, wobei sich die Hydroxylgruppe der Derivate des Hydroxyprolin an verschiedenen C-Atomen des Ringes von C 3 bis C 5 befindet.
7. Ein Derivat des Prolin, gekennzeichnet durch folgende Bezeichnung: N-Methyl-l-prolin.
8. Ein Derivat des Hydroxyprolin gekennzeichnet durch folgende Bezeichnung: N-Methyl-cis-4-hydroxy-l-prolin.
9. Ein Derivat des Hydroxyprolin gekennzeichnet durch folgende Bezeichnung: N-Methyl-trans-4-hydroxy-l-prolin.
10. Unterstützung der Wirkung eines Arzneimittels nach den Ansprüchen 1 - 6, durch die Zufügung von N-Methyl-glycin.

Dr. Wilhelm Hoerrmann
Staltacherstr. 34
D-8127 Iffeldorf

Arzneimittel, die Derivate
des Prolin oder Hyalonyprolin
enthalten

BAD ORIGINAL

COPY

Die Erfindung betrifft ein Arzneimittel, das als Wirksubstanz mindestens ein Derivat des Prolin oder Hydroxyprolin, bevorzugt ein N-Alkyl-Derivat des Prolin oder Hydroxyprolin, insbesondere das N-Methyl-Derivat des Prolin oder Hydroxyprolin oder dessen pharmazeutisch annehmbaren Abkömmling, ggf. zusammen mit üblichen Trägern und/oder Hilfsmitteln, enthält. Dabei ist zu beachten, dass das Derivat des Prolin oder Hydroxyprolin in der l- oder d-Konfiguration vorliegen kann, dass es sich bei dem Derivat des Hydroxyprolin um das cis- oder trans-Isomere handeln kann, und dass sich die Hydroxylgruppe des Derivates des Hydroxyprolin an verschiedenen C-Atomen des Ringes von C 3 bis C 5 befinden kann.

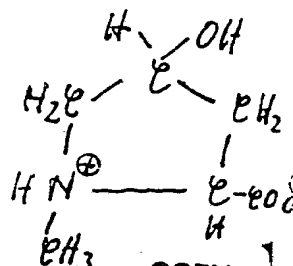
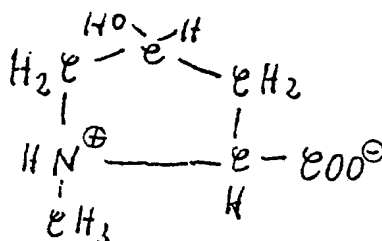
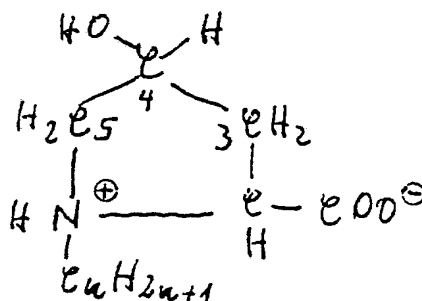
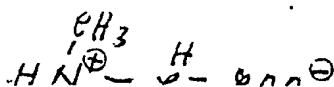
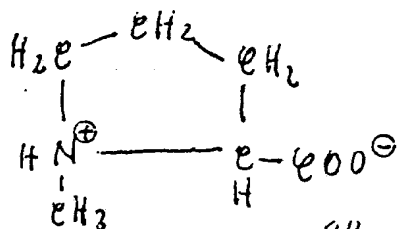
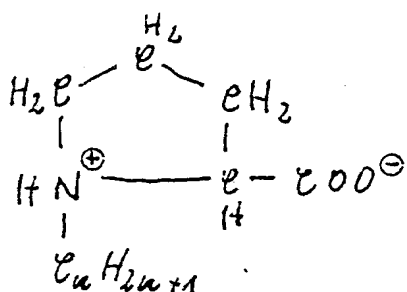
Die Erfindung betrifft weiterhin ein Derivat des Prolin, nämlich das N-Methyl-l-prolin.

Die Erfindung betrifft weiterhin zwei Derivate des Hydroxyprolin, nämlich das N-Methyl-cis-4-hydroxy-l-prolin und das N-Methyl-trans-4-hydroxy-l-prolin.

Alle Verbindungen können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden.

Die Wirkung der Arzneimittel kann durch die Zugabe von N-Methylglycin gesteigert werden (jedoch höchstens bis zu 2 Mol N-Methylglycin auf 1 Mol Hydroxyprolinderivat, bzw. höchstens 4 Mol N-Methylglycin auf 1 Mol Hydroxyprolinderivat und 1 Mol Prolinderivat.)

Strukturformeln der Aufgeführten Verbindungen:



Die Ergebnisse, die bisher bei Krebs und Viruserkrankungen, bei Erkrankungen des Gefäß- und Nervensystems medikamentös therapeutisch erzielt werden können, lassen vielfach in hohem Masse zu wünschen übrig, sei es dass die Wirkungen zu gering, die Nebenwirkungen aber zu hoch sind. Der Erfindung liegt daher die Aufgabe zugrunde, ein Arzneimittel zur Verfügung zu stellen, das bei weniger Nebenwirkungen, die genannten krankhaften Veränderungen in einem besseren Masse lindern oder heilen kann. Diese Aufgabe wird durch ein Arzneimittel dieser Art gelöst.

Wenn von den genannten Derivaten des Prolin und Hydroxyprolin nur eines von beiden verwandt wird, ist das des Hydroxyprolin zu bevorzugen, bei gemeinsamer Verwendung ist ein Äquimolares Verhältnis bevorzugt.

Die erfindungsgemässen Arzneimittel können die Derivate des Prolin und Hydroxyprolin auch in Form von pharmazeutisch verträglichen Abkömmlingen enthalten, besonders solche, die im Körper in die freie Form der Derivate übergehen. Hier können säureamidartige, ätherartige, esterartige und ähnliche Verbindungen mit der Amino-, Hydroxyl oder Carboxyl-Gruppe genannt werden. Insbesondere sind Oligo- oder Polypeptide ein typisches Beispiel hierfür.

Die erfindungsgemässen Arzneimittel werden in grundsätzlich gleicher Weise verabreicht wie die gewöhnlichen Aminosäuren, also bevorzugt peroral oder intravenös bzw. zentralintravenös. Auch die Zufuhr in Tabletten, Dragees, Injektions und Infusionslösungen ist die gleiche.

Auch die Dosierung liegt im üblichen Aminosäurenbereich, wobei man 0,01 - 0,1 g/kg pro Tag zugrunde legen kann.

Die für alle Aminosäuren geltenden Kontraindikationen sind auch hier zu beachten.

Iffeldorf 18.5.85

Dr. Wilhelm Körmann